## 特 許 協 力 条 約

REC'D 1 0 MAR 2005

PCT

## 特許性に関する国際予備報告(特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条) [PCT36条及びPCT規則70]

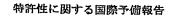
	<del></del>				
出願人又は代理人 の告類記号 Y0410-PCT	今後の手続きについては、	様式PCT/	IPEA/416	を参照する	こと。
国際出願番号 PCT/JP2004/004794	国際出願日 (日.月.年) 01.04.		優先日 (日.月.年) 0		
国際特許分類 (IPC) Int. Cl' C	07D401/0.6, A6J	K31/472	5, A61P9/	10, 43,	/0 o
出願人 (氏名又は名称) 山之内製薬株式会	<u></u>				·
<ol> <li>この報告書は、PCT35条に基づき 法施行規則第57条(PCT36条)の</li> </ol>	この国際予備審査機関で作 規定に従い送付する。	 成された国際予	 備審査報告であ	<del></del> る。 .	
2. この国際予備審査報告は、この表紙を	含めて全部で4_	ページ:	<b>からなる。</b>		
3.この報告には次の附属物件も添付され a 附属書類は全部で	ている。 ページである。				
□ 補正されて、この報告の基礎 囲及び/又は図面の用紙 (P	とされた及び/又はこの国 C T 規則70.16及78実施細8	際予備審査機関   第60284	が認めた訂正を行	うむ明細書、	請求の範
第 I 欄 4. 及び補充欄に示しる 国際予備審査機関が認定した。	をように 出版時によれて	19900/芳麥魚	R)		
b 電子媒体は全部で					ĺ
配列表に関する補充欄に示すよ ブルを含む。(実施細則第80	)に、コンピュータ読み取り ? 号参照)	の可能な形式に。	(電子媒体 よる配列表又は面	の種類、数 P列表に関連	を示す)。 連するテー
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含			•		
区 第1欄 国際予備審査報告		•			
第11欄 優先権 第11欄 新規性、進歩性又 図 第1V欄 発明の単一性の欠	は産業上の利用可能性につ	いての国際予備	森杏部告の不作。	<del>.b</del>	
区 第V欄 PCT35条(2)に	ロ 規定する新規性、進歩件 D	'け産業 Lの利用		X.	
□ 第VI欄 ある種の引用文献	が説明	・「本性米土・ジャリナ	りり胎性について	の見解、そ	れを裏付し
□ 第VⅢ欄 国際出願の不備 □ 第VⅢ欄 国際出願に対する類	<b></b>				
国際予備審査の請求費を受理した日	国際予備	審査報告を作成	1 2 0		
06.07.2004		23. (	2. 2005		
称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP)	特許庁審:	査官(権限のあ		4C :	3 2 2 9
郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3-	_	渡辺 仁		<u></u>	
1 日本街 37		03-358	1-1101 #	ake o Ae	.

## 特許性に関する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP2004/004794

	この報告は、		毎にトス細部や	が、国際出願の言語を基礎とした。 を基礎とした。
Г		ロッく返回された	研訳▼の言語では	<b>ホス</b>
Ļ		則12.3及び23.1(b)	)にいう国際調査	
		到12.4にいう国際		
L	」 「しょ規算	則55.2又は55.3に	いう国際予備審査	<b>5</b>
2. この た差替:	の報告は下記の え用紙は、この	出願害類を基礎と 報告において「出	: した。(法第6:  原時」とし、こ	条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出さ の報告に添付していない。)
	出願時の国際			
	明細醬			
	第		ページ、	出願時に提出されたもの
	第 		ページ*、	仕はったFIMt マ /th/de-de l/U pp a a a a
	奶		ページ*、	一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一
. 🖂	請求の範囲			一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一
-	第		· T智	川岡味)を担けるとよう。
	第			出願時に提出されたもの PCT19条の規定に基づき補正されたもの
	第	-		1 0119 泉の規定に基づき補正されたもの 一 付けで国際予備審査機関が受理したも
	第			
	図面			一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一
	第		~~~ c* /km	Ut per net and less and de
	第		_ ハーシノ図、	出願時に提出されたもの
				Plane amount of
_	第 配列表又は関連 配列表に関	<b>゙</b> するテーブル		
	配列表又は関連 配列表に関		でである。 関すること。	
	配列表又は関連配列表に関連を対象に関連を対象に関連を対象に関連を対象に関連を対象を対象を対象を対象を対象を対象を対象を対象を対象を対象を対象を対象を対象を	型するテーブル 関する補充欄を参照 記の書類が削除さ	でである。 関すること。	
	配列表又は関連 配列表に関 補正により、下 明細傳 間球の範囲	望するテーブル 引する補充概を参照 記の書類が削除さ 第  第	でである。 関すること。	
	配列表又は関連 配列表に関 補正により、下 明細傳 開求の範囲	望するテーブル 引する補充欄を参照 記の書類が削除さ 第 第 第	関すること。 られた。	
	配列表又は関連配列表又は関連を記列表により、下側部のののでは、一切ののでは、一切ののでは、一切ののでは、一切ののでは、一切ののでは、一切ののでは、一切では、一切では、一切では、一切では、一切では、一切では、一切では、一切	型するテーブル 引する補充欄を参照 記の書類が削除さ 第 第 体的に記載するこ	まれた。	一 付けで国際予備審査機関が受理したもの         付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配列表又は関連配列表又は関連を記列表により、下側部のののでは、一切ののでは、一切ののでは、一切ののでは、一切ののでは、一切ののでは、一切ののでは、一切では、一切では、一切では、一切では、一切では、一切では、一切では、一切	望するテーブル 引する補充欄を参照 記の書類が削除さ 第 第 第	まれた。	一 付けで国際予備審査機関が受理したもの         付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配列表又は関連配列表又は関連を記列表により、下側部の関連を関連を関する。  「「「「「「」」では、一、「「」」では、一、「「」」では、一、「「」」では、一、「「」」では、一、「「」」では、一、「「」」では、一、「「」」では、一、「「」」では、一、「「」、「「」、「「」、「「」、「「」、「「」、「「」、「「」、「「」、「	望するテーブル 引する補充欄を参照 記の書類が削除さ 第 第 ( 年的に記・プル ( 連するテーブル (	限すること。 された。 と) (具体的に記載す	付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配列表又は関連を対しては関連を対しては関連を対しては、細球の関連を対して、関連の関連を対して、関連の対象をは、関連を対して、関連を対して、関連を対して、関連を対して、関連を対して、関連を対して、対して、対して、対しては、対しては、対しては、対しては、対しては、対して	はするテーブル 引する補充欄を参照 記の書類が削除さ 第第 第第 記記・ を的にこテープル( をがして、 をがして、 ながしで、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 なが	限すること。 いた。 と) 人具体的に記載する	一       付けで国際予備審査機関が受理したもの         付けで国際予備審査機関が受理したもの         ページ       項         ページ/図       ること)
	配列表又は関連を対しては関連を対しては関連を対しては、細球の関連を対して、関連の関連を対して、関連の対象をは、関連を対して、関連を対して、関連を対して、関連を対して、関連を対して、関連を対して、対して、対して、対しては、対しては、対しては、対しては、対しては、対して	はするテーブル 引する補充欄を参照 記の書類が削除さ 第第 第第 記記・ を的にこテープル( をがして、 をがして、 ながしで、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 なが	限すること。 いた。 と) 人具体的に記載する	付けで国際予備審査機関が受理したもの         付けで国際予備審査機関が受理したもの         ページ         項         ページ/図         ること)
	配列表又は関連を対しては関連を対しては関連を対しては、細球の関連を対して、関連の関連を対して、関連の対象をは、関連を対して、関連を対して、関連を対して、関連を対して、関連を対して、関連を対して、対して、対して、対しては、対しては、対しては、対しては、対しては、対して	型するデーブル を	限すること。 いた。 と) 人具体的に記載する	付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配列表記をは、明静図配配をいると、明神図配配をいると、細求面列表とは、もので、明静図配配をいると、もので、のので、のので、ものので、のので、のので、のので、のので、のので、のの	はするテーブル 引する補充欄を参照 記の書類が削除さ 第第 第第 記記・ を的にこテープル( をがして、 をがして、 ながしで、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 ながして、 なが	限すること。 いた。 と) 人具体的に記載する	付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配列表記を開始を表現を表現を表現を表現を表現を表現を表現を表現を表現を表現を表現を表現を表現を	はする デーブル デーブル で表補 で表類が 前角 第第第 歌地 にいる にいる にいる にいる にいる にいる にいる にいる	はすること。 された。 と) 人具体的に記載する に、この報告に対 に、その補正がされ	付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配を相は、明静図配配を対して、明静図配配を対して、明静図配配を対して、明静図配配を対したので、ものでは、ものをは、ものをは、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、	はする ・	はすること。 された。 と) 人具体的に記載する に、この報告にお こ。その補正がされ	付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配を相は、明静図配配を対して、明静図配配を対して、明静図配配を対して、明静図配配を対したので、ものでは、ものをは、ものをは、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、	はする デーブル デーブル で表補 で表類が 前角 第第第 歌地 にいる にいる にいる にいる にいる にいる にいる にいる	はすること。 された。 と) 人具体的に記載する に、この報告にお こ。その補正がされ	付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配を相は、明静図配配を対して、明静図配配を対して、明静図配配を対して、明静図配配を対したので、ものでは、ものをは、ものをは、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、	はする ・	はすること。 された。 と) 人具体的に記載する に、この報告にお こ。その補正がされ	付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配を相は、明静図配配を対して、明静図配配を対して、明静図配配を対して、明静図配配を対したので、ものでは、ものをは、ものをは、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、	はする ・	はすること。 された。 と) 人具体的に記載する に、この報告にお こ。その補正がされ	付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配を相は、明静図配配を対して、明静図配配を対して、明静図配配を対して、明静図配配を対したので、ものでは、ものをは、ものをは、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、は、ものをは、	はする ・	はすること。 された。 と) 人具体的に記載する に、この報告にお こ。その補正がされ	付けで国際予備審査機関が受理したもの
	配 補 【】【】】 のて 関節図配配 報さ 明節図配配 報さ 明節図配配 報さ 明節図配配 又列 よ 細求面列列 告れ 細求面列列 はた 書の 妻をはた 書の 妻をに、も 範(に 、も 範(に 、も 範(に 、 関関に 下 囲 具関 補の 囲 具関	はする。 記する。 書する。 書類が開発が ののののででである。 にるのののでである。 にるののでである。 にるののでである。 にあるののでである。 にあるののでである。 にあるのでである。 にあるのでである。 にあるのでである。 にあるのでである。 にあるのでである。 にあるのである。 にあるのである。 にからいている。 にがしている。 にがしないる。 にがしないる。 にがしないる。 にがしないる。 にがしないる。 にがしない。 にがしないる。 にがしない。 にがしい。 にがし、 にがしい。 にがしい。 にがしい。 にがしい。 にがしい。	はすること。 された。 と) 具体的に記載する に、この報告になる。 その補正がされ と)	付けで国際予備審査機関が受理したもの

第IV欄 発明の単一性の欠如
1.
間求の範囲を減縮した。
追加手数料を納付した。 ・
□ 追加手数料の納付と共に異識を申立てた。
□ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。
2. X 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規 に従い、簡求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。
3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。
満足する。
X 以下の理由により満足しない。
請求の範囲1-3及び4-6の共通事項は、「(-)-N-{2-[(R)-3-(6,7-ジメトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-カルボニル)ピペリジノ]エチル}-4-7ルオロベンズアミドーリン酸塩」のみであるが、例えば、WO 00/75 前に公知の物質であるから、該化合物を先行技術に対して貢献する技術的特徴と認めることはできない。
してみると、両クレーム群は、特別な技術的特徴を共有するものとはいえないから、これらの一群の発明は単一の一般的発明概念を形成するように関連しているとは認められない。
,
4. したがって 国際出席の状态ができ
4. したがって、国際出願の次の部分について、この報告を作成した。  X すべての部分
□ 請求の範囲
に関する部分 に関する部分



国際出願番号 PCT/JP2004/004794

見解			
新規性 (N)	請求の範囲 請求の範囲	1-6	
進歩性(IS)	請求の範囲 請求の範囲	1-6	
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲 ・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・	1-6	

## 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献1:WO 00/75133 A1 (山之内製薬株式会社) 2000.12.14

請求の範囲1-6に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1より進歩性を 有しない。

文献 1 には、(-)-N- $\{2-[(R)-3-(6,7-ジメトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-カルボニル) ピペリジノ] エチル<math>\}$ -4-フルオロベンズアミドーリン酸塩及び該化合物を有効成分とする医薬組成物が記載されている(請求項1-6、実施例4 該化合物を有効成分とする医學組成物が記載されている(明本場ユーロ、天地のは 9)。また、単離、精製は、結晶化等の通常の化学的操作を適用して行われる旨も 記載されている(第8/1頁第3~4行)。 したがって、文献1に記載された発明において、結晶化の際に、溶媒、温度等の 条件を適宜変更し、製剤化に有利な結晶を得ることは、当業者が容易に想到し得る

ことであり、当該事項による格別の効果も認められない。